

【公報種別】 特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載
【部門区分】 第 3 部門第 2 区分
【発行日】 令和 5 年 10 月 11 日 (2023.10.11)

【公開番号】 特開 2023-40169 (P2023-40169A)
【公開日】 令和 5 年 3 月 22 日 (2023.3.22)
【年通号数】 公開公報 (特許) 2023-053
【出願番号】 特願 2023-1554 (P2023-1554)
【国際特許分類】

A 6 1 K 38/17 (2006.01)

10

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/145 (2006.01)

A 6 1 K 31/664 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

20

C 1 2 N 15/12 (2006.01)

C 0 7 K 14/435 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 38/17 Z N A

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 31/343

A 6 1 K 31/52

A 6 1 K 31/145

A 6 1 K 31/664

30

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 K 39/395 V

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 1 2 N 15/12

C 0 7 K 14/435

【手続補正書】

【提出日】 令和 5 年 10 月 2 日 (2023.10.2)

40

【手続補正 1】

【補正対象書類名】 特許請求の範囲

【補正対象項目名】 全文

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

対象における水疱性類天疱瘡または後天性表皮水疱症を治療または予防するための薬剤であって、

前記薬剤が、ロイコトリエンまたはヒドロキシエイコサノイド結合活性を示し、かつ、

50

減少したC5結合性を示すか、またはC5結合性を示さない改変コバーシポリペプチドであって、前記改変コバーシポリペプチドは、配列番号4において1～30のアミノ酸置換がなされた配列を含み、但し

a) 配列番号4の114～124位に、以下の置換：

a. Met116が、Gln、Asp、Asn、Glu、Arg、Lys、Gly、Ala、Pro、His、またはThrで置換されている；

b. Leu117が、Ser、Asp、Asn、Glu、Arg、Lys、Gly、Ala、またはProで置換されている；

c. Gly121が、Ala、Asp、Asn、Glu、Arg、Lys、Leu、Ile、Phe、Tyr、Met、Pro、またはHisで置換されている；

d. Leu122が、Asp、Glu、Asn、Ala、Gln、Arg、Lys、Pro、またはHisで置換されている；

e. Glu123が、Asp、Ala、Gln、Asn、Arg、Lys、Gly、Leu、Ser、Ile、Phe、Tyr、Pro、His、またはThrで置換されている；

のうち1または2以上がなされている改変コバーシポリペプチド、または前記改変コバーシポリペプチドのN末端から最大5つのアミノ酸が欠失されているその断片である、前記薬剤。

【請求項2】

(i) 配列番号4中のAla44が、Asn、Asp、Gln、Glu、Arg、Lys、Leu、Ile、Phe、Tyr、Met、Pro、またはHisで置換されている；および

(ii) 配列番号4中のAsp149が、Gly、Gln、Asn、Ala、Met、Arg、Lys、Leu、Ser、Ile、Phe、Tyr、Pro、His、またはThrで置換されている、

請求項1に記載の薬剤。

【請求項3】

配列番号4の114～124位において：

(i) Met114が、Gln、Asp、Asn、Glu、Arg、Lys、Gly、Ala、Pro、His、またはThrで置換されている；

(ii) Asp118が、Asn、Gln、Arg、Lys、Gly、Ala、Leu、Ser、Ile、Phe、Tyr、Met、Pro、His、またはThrで置換されている；

(iii) Ala119が、Gly、Asp、Asn、Glu、Arg、Lys、Leu、Ile、Phe、Tyr、Met、Pro、またはHisで置換されている；

(iv) Gly120が、Ser、Asp、Asn、Glu、Arg、Lys、Leu、Ile、Phe、Tyr、Met、Pro、またはHisで置換されている；および

(v) Val124が、Lys、Gln、Asn、Arg、Lys、Gly、Ala、Pro、His、またはThrで置換されている、

請求項1に記載の薬剤。

【請求項4】

配列番号4の114～124位において：

a. Met116が、Glnで置換されている；

b. Leu117が、Serで置換されている；

c. Gly121が、Alaで置換されている；

d. Leu122が、Aspで置換されている；および

e. Glu123が、Alaで置換されている；

請求項1または2に記載の薬剤。

【請求項5】

配列番号4のAla44が、Asnで置換され、配列番号4のAsp149が、Gly

10

20

30

40

50

149で置換されている、請求項4に記載の薬剤。

【請求項6】

配列番号4のTrp115が置換されていない、請求項1から5のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項7】

配列番号4のMet114、Trp115、Asp118、Ala119、Gly120およびVal124が置換されていない、請求項1、2、または4～6のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項8】

配列番号4のアミノ酸位置114～124の間に配列番号28に示されるループ配列を有し、配列番号23に示される置換以外に、配列番号4と比較して1～20の追加的な置換を有し、任意選択で、

(i) 配列番号23に示される置換以外に、配列番号4と比較して2～15の追加的な置換を有する；または

(ii) 配列番号23に示される置換以外に、配列番号4と比較して3～10の追加的な置換を有する、

請求項1、2、または4～7のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項9】

(a) 配列番号4の6、38、100、128、129、150位にある6つのシステインアミノ酸が、未改変形態で保持されている；

(b) 配列番号4のAsn60およびAsn84は、それぞれGlnで置換されている；

(c) 配列番号4中の以下のアミノ酸：Phe18、Tyr25、Arg36、Leu39、Gly41、Pro43、Leu52、Val54、Met56、Phe58、Thr67、Trp69、Phe71、Gln87、Arg89、His99、His101、Asp103、およびTrp115のうち1または2以上、あるいは全てが置換されていない；

(d) 配列番号4中の5、6、11、13～15、20～21、24～27、29～32、35～41、45、47～48、50、52～60、64、66、69～81、83、84、86、90～94、97～104、112～113、115、125～129、132～139、145、148、および150位のアミノ酸はいずれも置換されていない；

(e) 配列番号4中の5、6、11、13～15、18、20～21、24～27、29～32、35～41、43、45、47～48、50、52～60、64、66、67、69～81、83、84、86、87、89、90～94、97～104、112～113、115、125～129、132～139、145、148、および150位のアミノ酸はいずれも置換されていない；および／または

(f) 配列番号4中の5、6、11、13～15、18、20～21、24～25、27、30～32、35～41、43、47～48、50、52～60、64、66、67、69～81、83、84、86、87、89、90～94、98、100、102～104、112～113、115、126、128～129、132～139、145、148、および150位のアミノ酸はいずれも置換されていない；

請求項1、2、または4～8のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項10】

配列番号23の塩基配列を含むか、または配列番号23の塩基配列からなる、請求項1、2、または4～8のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項11】

LTB4に結合する、請求項1～10のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項12】

(a) 薬剤が、皮下投与されるものである；および／または

10

20

30

40

50

(b) 対象が、ヒトである

請求項 1 ～ 1 1 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

【請求項 1 3】

(a) 薬剤が、対象において可能な限り多くの利用可能な L T B 4 と結合するために十分な用量で投与される；および／または

(b) 薬剤が、対象において全ての利用可能な L T B 4 と結合するために必要なモル用量の 1 . 5 倍の用量で投与される、請求項 1 ～ 1 2 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

【請求項 1 4】

薬剤が、対象に当該薬剤の初回負荷用量で投与され、次にその維持用量で投与される、請求項 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

10

【請求項 1 5】

初回維持用量および 1 または 2 以上のさらなる維持用量がある、請求項 1 4 に記載の薬剤。

【請求項 1 6】

薬剤が、第 2 の A I B D 治療とともに投与される、請求項 1 ～ 1 5 のいずれかに記載の薬剤。

【請求項 1 7】

第 2 の A I B D 治療が、全身コルチコステロイド療法、局所コルチコステロイド療法、免疫抑制療法および免疫抑制生物学的療法から選択される、請求項 1 6 に記載の薬剤。

【請求項 1 8】

コルチコステロイドがプレドニゾン及びプレドニゾロンから選択されるものであり、免疫抑制療法が、メチルプレドニゾロン、ミコフェノレート、アザチオプリン、ダブソンおよびシクロホスファミドから選択されるものであり、免疫抑制生物学的療法が、リツキシマブおよび静脈内免疫グロブリン G (I V I G) から選択されるものである、請求項 1 7 に記載の薬剤。

20

【請求項 1 9】

水疱性類天疱瘡を治療するための薬剤である、請求項 1 ～ 1 8 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

【請求項 2 0】

対象における水疱性類天疱瘡または後天性表皮水疱症を治療または予防するための薬剤であって、

30

前記薬剤が、(a) 請求項 1 ～ 1 9 のいずれかに記載の改変コバーシンプリペプチド、および (b) 第 2 の配列、を含む融合タンパク質である、前記薬剤。

【請求項 2 1】

前記第 2 の配列が

(i) P A S 配列を含む；または

(ii) 配列番号 1 5 の 3 0 コピーからなる P A S 配列を含み、改変コバーシンプリペプチドの N 末端に融合されている、

請求項 2 0 に記載の薬剤。

40